

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA EN VIRTUD DEL TRATADO DE COOPERACIÓN
EN MATERIA DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de la Propiedad
Intelectual
Oficina internacional



(43) Fecha de publicación internacional
7 de Julio de 2005 (07.07.2005)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional
WO 2005/061431 A1

(51) Clasificación Internacional de Patentes⁷:
C07C 215/54, 217/54,
213/08, 213/10, 47/27, 45/29, 45/58

PARQUE TECNOLÓGICO DE BOECILLO, PARCELAS
2 Y 3, E-47151 BOECILLO (VALLADOLID) (ES).

(21) Número de la solicitud internacional:
PCT/ES2004/000572

(74) Mandatario: **ARIAS SANZ, Juan**; ABG Patentes, S.L.,
Orense, 68 7th floor, E-28020 MADRID (ES).

(22) Fecha de presentación internacional:
21 de Diciembre de 2004 (21.12.2004)

(81) Estados designados (*a menos que se indique otra cosa,
para toda clase de protección nacional admisible*): AE,
AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY,
BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ,
EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID,
IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Idioma de presentación: español

(26) Idioma de publicación: español

(30) Datos relativos a la prioridad:
P200303032
22 de Diciembre de 2003 (22.12.2003) ES

(84) Estados designados (*a menos que se indique otra cosa,
para toda clase de protección regional admisible*): ARIPO
(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ,
UG, ZM, ZW), euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD,
RU, TJ, TM), europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Solicitante (*para todos los Estados designados salvo
US*): **RAGACTIVES, S.L.** [ES/ES]; PARQUE TEC-
NOLÓGICO DE BOECILLO, PARCELAS 2 Y 3, E-47151 BOE-
CILLO (VALLADOLID) (ES).

(72) Inventores; e

(75) Inventores/Solicitantes (*para US solamente*): **PASCUAL
COCA, Gustavo** [ES/ES]; PARQUE TECNOLÓGICO
DE BOECILLO, PARCELAS 2 Y 3, E-47151 BOE-
CILLO (VALLADOLID) (ES). **MARTÍN PASCUAL,
Pablo** [ES/ES]; PARQUE TECNOLÓGICO DE BOE-
CILLO, PARCELAS 2 Y 3, E-47151 BOECILLO (VAL-
LADOLID) (ES). **MARTÍN JUÁREZ, Jorge** [ES/ES];

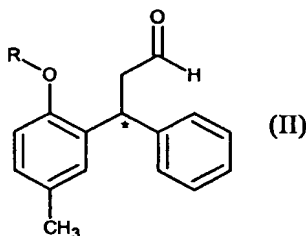
Publicada:

— con informe de búsqueda internacional

Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, véase la sección
"Guidance Notes on Codes and Abbreviations" que aparece al
principio de cada número regular de la Gaceta del PCT.

(54) Title: METHOD OF OBTAINING TOLTERODINE

(54) Título: PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCIÓN DE TOLTERODINA



(57) Abstract: The invention relates to a method of obtaining tolterodine. The inventive method consists in: reacting a compound having formula (II), wherein R is a hydroxyl protective group and the asterisk indicates an asymmetric carbon atom, with diisopropylamine in the presence of a reducing agent; optionally, converting the resulting intermediate into a salt, and, if desired, isolating same; removing the hydroxyl protective group; and, if desired, separating the desired enantiomer (R) or (S) or the mixture of enantiomers and/or converting the compound thus obtained into a pharmaceutically-acceptable salt thereof. Tolterodine is a muscarinic receptor antagonist which can be used in the treatment of urinary incontinence and other symptoms of urinary bladder hyperactivity.

(57) Resumen: El procedimiento comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II), donde R es un grupo protector de hidroxilo, y el asterisco indica un átomo de carbono asimétrico, con diisopropilamina en presencia de un agente reductor; opcionalmente convertir el intermedio resultante en una sal y, si se desea, aislarla; retirar el grupo protector del hidroxilo; y, si se desea, separar el enantiómero (R) o (S) deseado, o la mezcla de enantiómeros, y/o convertir el compuesto obtenido en una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. La tolterodina es un antagonista de los receptores muscarínicos útil en el tratamiento de la incontinencia urinaria y de otros síntomas de hiperactividad de la vejiga urinaria.

WO 2005/061431 A1